

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization

International Bureau



(43) International publication date

18 December 2003 (18.12.2003)

PCT

(10) International publication number

WO 03/104303 A1

(51) International patent classification⁷:

C08G 69/10, A61K 47/34, 47/42, 9/51, C08G 69/48

(81) Designated states (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(21) International application number:

PCT/FR03/50003

(22) International filing date:

3 June 2003 (03.06.2003)

(25) Language of filing:

French

(26) Language of publication:

French

(30) Data relating to the priority:

02/07,008 7 June 2002 (07.06.2002)

FR

(71) Applicant (for all designated States except US): FLAMEL TECHNOLOGIES [FR/FR]; 33 avenue du Docteur Georges Lévy, F-69200 VENISSIEUX (FR).

(84) Designated states (regional): ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (US only): CHAN, You-Ping [FR/FR]; 14 bd Jean XXIII, F-69008 LYON (FR). ANGOT, Stéphanie [FR/FR]; 123 bis cours Albert Thomas, F-69003 LYON (FR). BREYNE, Olivier [FR/FR]; 5 rue Rosset, F-69004 LYON (FR).

(74) Representatives: CABINET PLASSERAUD etc., 84 rue d'Amsterdam, F-75440 PARIS CEDEX 09 (FR).

Published:

- With International Search Report.
- Before the expiration of the time limit for amending the claims and to be republished in the event of receipt of amendments.

For an explanation of the two-letter codes and the other abbreviations, reference is made to the explanations ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") at the beginning of each regular edition of the PCT Gazette.

As printed

(54) Title: POLYAMINOACIDS FUNCTIONALIZED BY ALPHA TOCOPHEROL AND USES THEREOF, PARTICULAR FOR THERAPEUTIC APPLICATIONS

(54) Titre : POLYAMINOACIDES FONCTIONNALISÉS PAR DE L'ALPHA-TOCOPHEROL ET LEURS APPLICATIONS NOTAMMENT THÉRAPEUTIQUES

(57) Abstract: The invention concerns novel biodegradable polyaminoacid materials, useful in particular for vectoring active principle(s). The invention also concerns novel pharmaceutical, cosmetic, dietary or phytosanitary compositions based on said polyaminoacids. The invention aims at providing a novel polymer raw material, capable of being used for vectoring active principles and enabling optimal fulfillment of all specified requirements: biocompatibility, biodegradability, easy and inexpensive transformation into particles vectoring active principles, said particles being themselves capable of forming colloidal suspensions, of being easily associated with numerous active principles, and of releasing said active principles in vivo. Therefor, the present invention concerns first of all amphiphilic polyaminoacids comprising aspartic acid units and/or glutamic acid units, characterized in that at least part of said units carry grafts including at least one alpha-tocopherol motif, for example (polyglutamate or polyaspartate grafted with alpha-tocopherol of synthetic or natural origin).

A1

WO 03/104303

(57) Abrégé : La présente invention concerne des nouveaux matériaux à base de polyaminoacides biodégradables, utiles notamment pour la vectorisation de principe(s) actif(s) (PA). L'invention vise aussi de nouvelles compositions pharmaceutiques, cosmétiques diététiques ou phytosanitaires à base de ces polyaminoacides. Le but de l'invention est de fournir une nouvelle matière première polymère, susceptible d'être utilisée pour la vectorisation de PA et permettant de satisfaire de manière optimale à toutes les spécifications du cahier des charges : biocompatibilité, biodégradabilité, aptitude à se transformer aisément et économiquement en particules de vectorisation de principes actifs, ces particules étant elles même propres à former des suspensions colloïdales aquatiques stables, à s'associer facilement avec de nombreux principes actifs, et à libérer ces principes actifs in vivo. Ce but est atteint par la présente invention qui concerne tout d'abord des polyaminoacides amphiphiles comprenant des unités aspartique et/ou des unités glutamiques, caractérisés en ce qu'au moins une partie de ces unités sont porteuses de greffons comportant au moins un motif alpha-tocophérol, e.g. : (polyglutamate ou polyaspartate greffé par l'alpha-tocophérol d'origine synthétique ou naturelle).

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande Internationale No
PCT/FR 03/50003A. CLASSEMENT DE L'OBJET DE LA DEMANDE
CIB 7 C08G69/10 A61K47/34 A61K47/42 A61K9/51 C08G69/48

Selon la classification internationale des brevets (CIB) ou à la fois selon la classification nationale et la CIB

B. DOMAINES SUR LESQUELS LA RECHERCHE A PORTE

Documentation minimale consultée (système de classification suivi des symboles de classement)

CIB 7 C08G A61K

Documentation consultée autre que la documentation minimale dans la mesure où ces documents relèvent des domaines sur lesquels a porté la recherche

Base de données électronique consultée au cours de la recherche internationale (nom de la base de données, et si réalisable, termes de recherche utilisés)

EPO-Internal

C. DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS

Catégorie	Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	no. des revendications visées
A	EP 0 179 023 A (BATTELLE MEMORIAL INSTITUTE) 23 avril 1986 (1986-04-23) le document en entier	
A	& US 4 888 398 A (BICHON ET AL) 19 décembre 1989 (1989-12-19) cité dans la demande	
A	WO 87 03891 A (BATTELLE MEMORIAL INSTITUTE) 2 juillet 1987 (1987-07-02) revendications	
A	US 6 320 017 B1 (ANSELL STEVEN MICHAL) 20 novembre 2001 (2001-11-20) revendications	

 Voir la suite du cadre C pour la fin de la liste des documents Les documents de familles de brevets sont indiqués en annexe

* Catégories spéciales de documents cités:

- *A* document définissant l'état général de la technique, non considéré comme particulièrement pertinent
- *E* document antérieur, mais publié à la date de dépôt international ou après cette date
- *L* document pouvant poser un doute sur une revendication de priorité ou cité pour déterminer la date de publication d'une autre citation ou pour une raison spéciale (telle qu'indiquée)
- *O* document se référant à une divulgation orale, à un usage, à une exposition ou tous autres moyens
- *P* document publié avant la date de dépôt international, mais postérieurement à la date de priorité revendiquée

- *T* document ultérieur publié après la date de dépôt international ou la date de priorité et n'appartenant pas à l'état de la technique pertinent, mais cité pour comprendre le principe ou la théorie constituant la base de l'invention
- *X* document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme nouvelle ou comme impliquant une activité inventive par rapport au document considéré isolément
- *Y* document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme impliquant une activité inventive lorsque le document est associé à un ou plusieurs autres documents de même nature, cette combinaison étant évidente pour une personne du métier
- *&* document qui fait partie de la même famille de brevets

Date à laquelle la recherche internationale a été effectivement achevée

23 octobre 2003

Date d'expédition du présent rapport de recherche internationale

30/10/2003

Nom et adresse postale de l'administration chargée de la recherche internationale
Office Européen des Brevets, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl
Fax (+31-70) 340-3016

Fonctionnaire autorisé

Leroy, A

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande internationale No
PCT/FR 03/50003

Document brevet cité au rapport de recherche	Date de publication	Membre(s) de la famille de brevet(s)	Date de publication
EP 0179023	A 23-04-1986	AT 60340 T CA 1336034 C DE 3581471 D1 EP 0179023 A2 JP 1963038 C JP 6089138 B JP 61101533 A US 4976962 A US 4888398 A	15-02-1991 20-06-1995 28-02-1991 23-04-1986 25-08-1995 09-11-1994 20-05-1986 11-12-1990 19-12-1989
WO 8703891	A 02-07-1987	CH 667874 A5 WO 8703891 A1 EP 0250492 A1 JP 63502037 T US 4892733 A	15-11-1988 02-07-1987 07-01-1988 11-08-1988 09-01-1990
US 6320017	B1 20-11-2001	US 2002026027 A1 AU 751434 B2 AU 1746099 A CA 2315695 A1 WO 9933493 A1 EP 1041976 A1 JP 2001527052 T	28-02-2002 15-08-2002 19-07-1999 08-07-1999 08-07-1999 11-10-2000 25-12-2001